

⑤ 日本国特許庁 (JP)

⑥ 特許出願公開

⑦ 公開特許公報 (A)

昭55—124763

⑧ Int. Cl.³
C 07 D 213/64
213/70

⑨ 識別記号
庁内整理番号
7138—4C
7138—4C

⑩ 公開 昭和55年(1980)9月26日

発明の種 1
審査請求 未請求

(全 3 頁)

⑪ 5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体

⑫ 発明者 芳賀隆弘

草津市野村町221番地

⑬ 特 願 昭54—32068

⑭ 発明者 長谷邦昭

⑮ 出 願 昭54(1979)3月19日

守山市浮気町321番地の31

⑯ 発明者 西山隆三

⑰ 発明者 林弘仁

高槻市真上町5丁目41番22号

守山市浮気町321番地の31

⑱ 発明者 藤川敬一

⑲ 出 願 人 石原産業株式会社

守山市浮気町321番地の31

大阪市西区江戸堀1丁目3番11号

⑳ 発明者 横道政

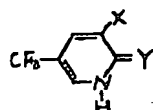
草津市野村町221番地

明 記 号

1. 発明の名称 5-トリフルオロメチル-2-
ピリドン誘導体

2. 特許請求の範囲

1. 一般式



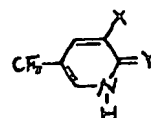
(式中Xは炭素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが炭素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で置換される5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体。

3. 図面の簡単な説明

本発明は図1、図2、図3などの中図面として有用で、図面を5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体に示す。

詳しくは本発明は一般式

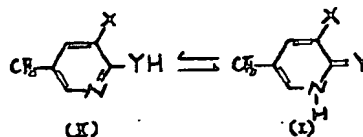
- 1 -



(I)

(式中Xは炭素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが炭素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で置換される5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体である。

図1一般式(I)の5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体は、図に示すような互置関係として存在することができる。



(X)

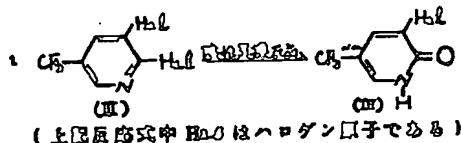
(Y)

(式中X及びYは図2の通りである)

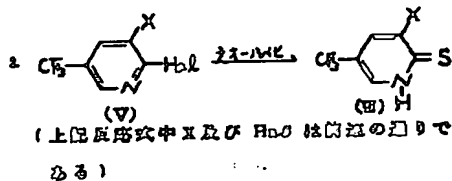
図1一般式(I)において、Xで置換されるハロゲン原子としては、図2、図3、図4、図5が例示される。

- 2 -

本発明の5-トリフルオロメチル-2-ピリジン環は、例えば下記方法によって得られる。



一般に上記反応はジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミドなどの溶媒中、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどのアルカリを添加剤を用いて50~150℃、0.1~10時間で行なわれる。



一般に上記反応はメタノール、エタノールなどのアルコール、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミドなどの溶媒中、

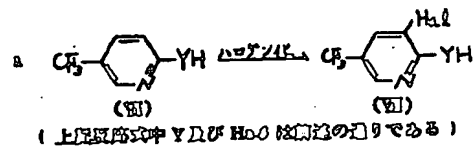
- 3 -

トリフルオロメチル基を付与することによりN-ベンゾイル-N'-[4-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)フェニル]ウレア系化合物に得られる。詳しくは本発明化合物の3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジンと3,4,5-トリクロロニトロベンゼンとを混合、還元して3,5-ジクロロ-4-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)アニリンを得、更にこのものと2,6-ジフルオロベンゾイルイソシアネートとを反応させると、N-(2,6-ジフルオロベンゾイル)-N'-[4-(3,5-ジクロロ-4-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)フェニル)ウレアを得ることができる。このものは、動物の有効成分として認められた。動物の有効成分、特に動物の有効成分に有効であって、例えばこの化合物100mg/kg体重に相当する量を投与し、それを観察してその2~3日の観察結果、8日目には生存を確認した結果、100%の

- 8 -

特許第124763(2)

などの動物中、チオエーテル、チオエーテル、N,N-ジメチルチオエーテル、N,N-ジメチルチオエーテルなどのチオエーテルを用いて50~100℃、0.5~10時間で行なわれる。



一般に上記反応は塩化炭素、クロロホルム、二硫化炭素、水、溶媒中、窒素ガス、臭素、チオニルクロライド、スルフィルクロライドなどのハロゲン化合物を用いて0~100℃、0.5~10時間で行なわれる。

本発明化合物は、例えばハロゲン化ニトロベンゼンと混合して4-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)ニトロベンゼンを生じさせ、これを還元して得られる4-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)アニリンとベンゾイルイソシアネート

- 4 -



死産物が得られた。

次に本発明化合物の具体的な合成例を記す。

合成例1 3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジン

(A)

5-トリフルオロメチル-2-ピリジン2.0gをクロロホルム20mlに溶解させ、50℃に加温して塩化炭素を1時間加熱した。反応終了後、クロロホルムを蒸発し、トルエン-0-ヘキサンの混合液で抽出して沸点144~147℃の目的物0.15gを得た。

(B)

水酸化ナトリウム2.4gを12.8mlに溶解させた溶液に2,3-ジクロロ-5-トリフルオロメチルピリジン4.0gを加え、更にジメチルスルホキシド12.8mlを加えて加熱し、110℃で1時間加熱した。反応終了後、生成物を抽出し、抽出液を蒸発して目的物を得、このものを再結晶して目的物2.5

- 6 -

ヲを得た。

合成例 2 5-トリフルオロメチル-2-チオ
ピリジン

2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリ
ジン4ヲとチオ尿素167ヲとをエタノール
30mlに溶解させ、加熱して還流状態で3時
間攪拌下に反応させた。その後、水酸化カリ
ウム水溶液123ヲを徐々に加えて還流状態
で1時間反応させた。反応終了後、生成物を
放冷し、希アルカリ水溶液中に投入して塩化
メチレンで洗浄し、酢酸で酸性にした。次い
で、塩化メチレンで抽出し、抽出層を水洗後
無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、塩化メチレ
ンを留去して融点147~150℃の目的物
21ヲを得た。

合成例 3 3-ブロモ-5-トリフルオロメチ
ル-2-ピリジン

5-トリフルオロメチル-2-ピリジン0.
4ヲを酢酸10mlに溶解させ、そこへ臭素0.
4ヲを加えて攪拌下で4時間反応させた。反

- 7 -

特願55-124783(3)

応終了後、酢酸を留去し、塩化メチレン-
ヘキサンの混合溶媒で再結晶して融点162
~165℃の目的物0.45ヲを得た。

合成例 4 3-クロロ-5-トリフルオロメチ
ル-2-チオピリジン

2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリ
ジン4ヲに代えて2,3-ジクロロ-5-トリ
フルオロメチルピリジン475ヲを用いる以
外は前記合成例2と同様にして反応を行ない、
後処理を行なって融点125~128℃の目
的物1.9ヲを得た。

特許出願人 石原産業株式会社

- 8 完 -